

⑬ 日本国特許庁 (JP)
⑭ 公開特許公報 (A)

⑮ 特許出願公開
昭55—124763

⑯ Int. Cl.³
C 07 D 213/64
213/70

識別記号 庁内整理番号
7138—4C
7138—4C

⑰ 公開 昭和55年(1980)9月26日

発明の数 1
審査請求 未請求

(全 3 頁)

⑱ 5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体

⑲ 特 願 昭54—32068

⑳ 出 願 昭54(1979)3月19日

㉑ 発 明 者 西山隆三
高槻市真上町5丁目41番22号

㉒ 発 明 者 藤川敢一
守山市浮気町321番地の31

㉓ 発 明 者 横道勲
草津市野村町221番地

㉔ 発 明 者 芳賀隆弘
草津市野村町221番地

㉕ 発 明 者 長谷邦昭
守山市浮気町321番地の31

㉖ 発 明 者 林弘仁
守山市浮気町321番地の31

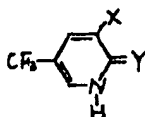
㉗ 出 願 人 石原産業株式会社
大阪市西区江戸堀1丁目3番11号

明 細 書

1. 発明の名称 5-トリフルオロメチル-2-
ピリドン誘導体

2. 特許請求の範囲

1. 一般式

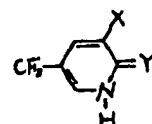


(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体。

3. 発明の詳細な説明

本発明は医薬、農薬、染料などの中間原料として有用で、新規な5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体に関する。

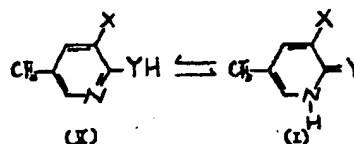
詳しくは本発明は一般式



(I)

(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体である。

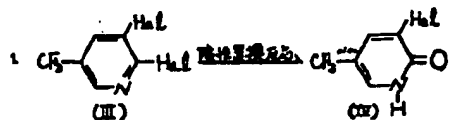
前記一般式(I)の5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体は、次に示すような互変異性として存在することができる。



(式中X及びYは前述の通りである)

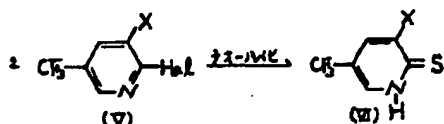
前記一般式(I)において、Xで表わされるハロゲン原子としては弗素、塩素、臭素、沃素が挙げられる。

本発明 5-トリフルオロメチル-2-ピリ
ドン誘導体は適、例えば下記方法によって製
造される。



(上記反応式中 Ha はハロゲン原子である)

一般に上記反応はジメチルスルホキシド、ジ
メチルホルムアミドなどの非プロトン性極性溶
媒中、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなど
のアルカリ水溶液を用いて50~150℃、0.1
~10時間で行なわれる。



(上記反応式中 X 及び Ha は前述の通りで
ある)

一般に上記反応はメタノール、エタノールな
どのアルコール類、ジメチルスルホキシド、ジ
メチルホルムアミドなどの非プロトン性極性溶

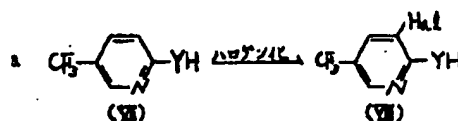
- 3 -

媒とを反応させることによりN-ベンゾイ
ル-N-[4-(5-トリフルオロメチルピリ
ジン-2-イルオキシ)フェニル]ウレア系化
合物に誘導できる。詳しくは本発明化合物の3
-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリ
ドンと3,4,5-トリクロロニトロベンゼンとを
縮合、還元して3,5-ジクロロ-4-(3-ク
ロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-
イルオキシ)アニリンを得、更にこのものと2
6-ジフルオロベンゾイルイソシアネートとを
反応させると、N-(2,6-ジフルオロベンゾ
イル)-N-[3,5-ジクロロ-4-(3-ク
ロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-
イルオキシ)フェニル]ウレアを得ることがで
きる。このものは殺虫剤の有効成分として優れた
活性を示し、種々の有害虫、特に有害昆虫の
防除に有効であって、例えばこの化合物²100
ppm水分散液にキャベツの葉片を浸漬し、それ
を風乾してそこへ2~3令のコナガの幼虫を放
ち、8日目に生死を判定した結果、100%の

- 5 -

特開55-124763(2)

死など 溶液中、チオ尿素、硫化ソーダ、チオ
硫酸ソーダ、N,N-ジメチルジチオカルバミ
ン酸ソーダなどのチオール化剤を用いて50~
還流温度0.5~10時間で行なわれる。



(上記反応式中 Y 及び Ha は前述の通りである)

一般に上記反応は固相化炭素、クロロホルム、
酢酸、二硫化炭素、水、非プロトン性極性溶媒
などの溶液中、塩素ガス、臭素、チオニクロ
ライド、スルフィルクロライドなどのハロゲン
化剤を用いて0~100℃、0.5~10時間で行な
われる。

本発明化合物は、例えばハロゲン化ニトロベ
ンゼン類と縮合させて4-(5-トリフルオロ
メチルピリジン-2-イルオキシ)ニトロベン
ゼン類を生成させ、これを還元して得られる4
-(5-トリフルオロメチルピリジン-2-イ
ルオキシ)アニリン類とベンゾイルイソシア

- 4 -

ネートとを反応させることによりN-ベンゾイ
ル-N-[4-(5-トリフルオロメチルピリ
ジン-2-イルオキシ)フェニル]ウレア系化
合物に誘導できる。詳しくは本発明化合物の3
-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ピリ
ドンと3,4,5-トリクロロニトロベンゼンとを
縮合、還元して3,5-ジクロロ-4-(3-ク
ロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-
イルオキシ)アニリンを得、更にこのものと2
6-ジフルオロベンゾイルイソシアネートとを
反応させると、N-(2,6-ジフルオロベンゾ
イル)-N-[3,5-ジクロロ-4-(3-ク
ロロ-5-トリフルオロメチルピリジン-2-
イルオキシ)フェニル]ウレアを得ることがで
きる。このものは殺虫剤の有効成分として優れた
活性を示し、種々の有害虫、特に有害昆虫の
防除に有効であって、例えばこの化合物²100
ppm水分散液にキャベツの葉片を浸漬し、それ
を風乾してそこへ2~3令のコナガの幼虫を放
ち、8日目に生死を判定した結果、100%の

死虫率を得られた。

次に本発明化合物の具体的合成例を記載する。

合成例 1 3-クロロ-5-トリフルオロメチ
ル-2-ピリドン

(A)

5-トリフルオロメチル-2-ピリドン0.
2gをクロロホルム20mlに溶解させ、50
℃に加温して塩素ガスを1時間攪拌下に通じ
た。反応終了後、クロロホルムを留去し、ト
ルエン-n-ヘキサンの混合溶媒で再結晶し
て融点144~147℃の目的物0.15gを得た。

(B)

水酸化ナトリウム2.4gを水12.5mlに溶
解させた水溶液に2,3-ジクロロ-5-トリ
フルオロメチルピリジン4gを加え、更にジ
メチルスルホキシド12.5mlを加えて加熱し、
110℃で1時間攪拌下に反応させた。反応
終了後生成物を放冷し、濃塩酸で酸性にして
沈殿物を得、このものを濾過して目的 2.5

- 6 -

ヲを得た。

合成例 2 5-トリフルオロメチル-2-チオ
ピリドン

2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリ
ジン4ヲとチオ尿素167ヲとをエタノール
30mlに溶解させ、加熱して還流状態で3時
間攪拌下に反応させた。その後、水酸化カリ
ウム水溶液123ヲを徐々に加えて還流状態
で1時間反応させた。反応終了後、生成物を
放冷し、希アルカリ水溶液中に投入して塩化
メチレンで洗浄し、酢酸で酸性にした。次い
で、塩化メチレンで抽出し、抽出層を水洗後
無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、塩化メチレ
ンを留去して融点147~150℃の目的物
2.1ヲを得た。

合成例 3 3-ブロモ-5-トリフルオロメチ
ル-2-ピリドン

5-トリフルオロメチル-2-ピリドン0
4ヲを酢酸10mlに溶解させ、そこへ臭素0
4ヲを加えて攪拌下で4時間反応させた。反

- 7 -

特開昭55-124763(3)

反応終了後、酢酸を留去し、塩化メチレン-
ヘキサン 混合溶媒で再結晶して融点162
~165℃の目的 0.45ヲを得た。

合成例 4 3-クロロ-5-トリフルオロメチ
ル-2-チオピリドン

2-クロロ-5-トリフルオロメチルピリ
ジン4ヲに代えて2,3-ジクロロ-5-トリ
フルオロメチルピリジン475ヲを用いる以
外は前記合成例2と同様にして反応を行ない、
後処理を行なって融点125~128℃の目
的物1.9ヲを得た。

特許出願人 石原産業株式会社

- 8 完 -